

10.660.794

03.05.04

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
19. September 2002 (19.09.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 02/072585 A3(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 487/04,  
513/04, A61K 31/505, A61P 25/00, 29/00 // (C07D  
487/04, 239:00, 231:00) (C07D 513/04, 277:00, 239:00)

101 53 344.6 29. Oktober 2001 (29.10.2001) DE

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/02722

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): GRÜNENTHAL GMBH [DE/DE]; Ziegler-  
strasse 6, 52078 Aachen (DE). UNIVERSITEIT LEIDEN  
[NL/NL]; Of Rapenburg 70, 2333 CC Leiden (NL).

(22) Internationales Anmeldedatum:

13. März 2002 (13.03.2002)

(72) Erfinder; und

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GERLACH, Matthias  
[DE/DE]; Pfarrgasse 1, 63636 Brachtal (DE). MAUL,  
Corinna [DE/DE]; Oppenhoffallee 83-85, 52066 Aachen  
(DE). JAGUSCH, Utz-Peter [DE/DE]; Bismarckstrasse  
161, 52066 Aachen (DE). SUNDERMANN, Bernd  
[DE/DE]; Oppenhoffallee 83-85, 52066 Aachen (DE).  
FUHR, Martin [DE/DE]; Diessemer Strasse 168, 47799

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

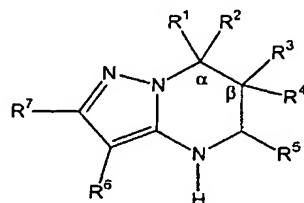
(30) Angaben zur Priorität:

101 12 197.0 14. März 2001 (14.03.2001) DE

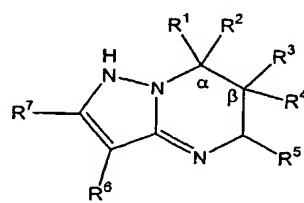
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: SUBSTITUTED PYRAZOLOPYRIMIDINES AND THIAZOLOPYRIMIDINES USED AS ANALGESICS

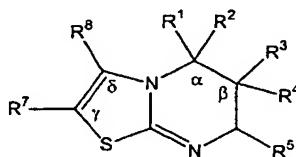
(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PYRAZOLO- UND THIAZOLOPYRIMIDINE ALS ANALGETIKA



(IA)



(IB)



(II)

(57) **Abstract:** The invention relates to substituted pyrazolopyrimidines and thiazolopyrimidines with the general structures (I A), (I B) and (II), to a method for their production, to substance libraries containing the same, to medicaments containing said compounds, to the use of said compounds in the production of medicaments for treating pain, epilepsy, schizophrenia, neurodegenerative diseases, in particular Alzheimer's disease, Huntington's disease and Parkinson's disease, for treating cerebral ischaemia and infarcts, psychosis caused by increased amino acid levels, cerebral oedema, conditions caused by an under-supply of the central nervous system, in particular in hypoxia, especially newborn hypoxia and anoxia, for treating AIDS-related dementia, encephalomyelitis, Tourette's syndrome, perinatal asphyxia, tinnitus, neuropathic pain, diseases of the respiratory tract, cancer, cardiac arrhythmia, immune disorders and diseases, inflammatory conditions and diseases, renal shutdown, dyssomnia, strokes, thromboses, urinary incontinence, diabetes, psoriasis, septicemic shock, cerebral traumas, glaucoma and/or congestive heart failure. The invention further relates to pharmaceutical compositions containing said compounds.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Pyrazolo- und Thiazolopyrimidine der allgemeinen Struktur (I A), (I B) und (II). Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Substanzbibliotheken, Arzneimittel, die diese Verbindungen enthalten, die

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]



WO 02/072585 A3



Krefeld (DE). **IJZERMAN, Adriaan, P.** [NL/NL]; Park Oosterspaam 6, NL-2036 MB Haarlem (NL). **DISSEN-DE GROOTE, Miriam** [NL/NL]; Arthur van Schendelplein 159, NL 2624 CW Delft (NL).

eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen**

**Recherchenberichts:**

20. Februar 2003

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*

Verwendung dieser Verbindungen zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung von Schmerz, Epilepsie, Schizophrenie, neurodegenerativen Erkrankungen, insbesondere Morbus Alzheimer, Morbus Huntington und Morbus Parkinson, von cerebralen Ischämien und Infarkten, von Psychosen bedingt durch erhöhten Aminosäurespiegel, Hirnödemen, Unterversorgungszuständen des zentralen Nervensystems, insbesondere bei Hypoxien, insbesondere Neugeborenen-Hypoxie, und Anoxien, von AIDS-Demens, von Encephalomyelitis, des Tourette-Syndroms, der perinatalen Asphyxie, bei Tinnitus, neurophathischem Schmerz, Atemwegserkrankungen, Krebs, kardialen Arrhythmien, Immunstörungen und -erkrankungen, Entzündungszuständen und -erkrankungen, neurodegenerativen Erkrankungen, Morbus Parkinson, Nierenversagen, Schizophrenie, Schlafstörungen, Schlaganfall, Thrombosen, Harninkontinenz, Diabeter, Psoriasis, septischem Schock, Gehirntraumata, Glaukom und/oder Stauungsinsuffizienz, sowie diese Verbindungen enthaltende pharmazeutische Zusammensetzungen.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interr Application No  
PCT/EP 02/02722

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D487/04 C07D513/04 A61K31/505 A61P25/00 A61P29/00  
/(C07D487/04,239:00,231:00),(C07D513/04,277:00,239:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 5 789 406 A (ALOUP JEAN-CLAUDE ET AL) 4 August 1998 (1998-08-04) the whole document	1-6,8-20
A	US 5 426 106 A (KULAGOWSKI JANUSZ J ET AL) 20 June 1995 (1995-06-20) the whole document	1-6,8-20
A	FR 2 722 786 A (RHONE POULENC RORER SA) 26 January 1996 (1996-01-26) the whole document	1-6,8-10
	--- -/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

6 September 2002

Date of mailing of the international search report

20.09.02

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fritz, M

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern al Application No  
PCT/EP 02/02722

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	KROGSGAARD-LARSEN P ET AL: "Design of excitatory amino acid receptor agonists, partial agonists and antagonists: ibotenic acid as a key lead structure" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR, vol. 31, no. 7, 1996, pages 515-537, XP004040229 ISSN: 0223-5234 the whole document	1-6,8-20
A	EP 0 398 283 A (MERRELL DOW PHARMA) 22 November 1990 (1990-11-22). the whole document	1-5, 7-15,20
A	US 5 602 144 A (GOTTSCHLICH RUDOLF ET AL) 11 February 1997 (1997-02-11) the whole document	1-5, 7-15,20

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
EP02/02722

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
  
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See supplemental sheet

1. ☒ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

### Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- ☒ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP02/02722

The International Searching Authority has determined that this international application contains more than one invention or group of inventions, namely

1. Claims 1-5 (part), 6, 8-15 (part), 16-19, 20 (part)

compounds Ia and IB, their preparation, substance libraries containing these compounds, their use for the manufacture of a drug and pharmaceutical compositions containing these compounds.

2. Claims 1-5 (part), 7-15 (part), 20 (part)

compounds II, their preparation, substance libraries containing these compounds, their use for the manufacture of a drug and pharmaceutical compositions containing these compounds.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern      Application No  
PCT/EP 02/02722

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5789406	A	04-08-1998	FR 2717812 A1	29-09-1995
			AT 180483 T	15-06-1999
			AU 2141295 A	17-10-1995
			DE 69509888 D1	01-07-1999
			DE 69509888 T2	30-09-1999
			DK 752991 T3	08-11-1999
			EP 0752991 A1	15-01-1997
			ES 2134459 T3	01-10-1999
			WO 9526349 A1	05-10-1995
			GR 3030273 T3	31-08-1999
			JP 9510726 T	28-10-1997
			ZA 9502531 A	11-01-1996
US 5426106	A	20-06-1995	GB 2265372 A	29-09-1993
FR 2722786	A	26-01-1996	FR 2722786 A1	26-01-1996
			AU 2984695 A	16-02-1996
			EP 0772612 A1	14-05-1997
			WO 9602536 A1	01-02-1996
			JP 10504027 T	14-04-1998
			ZA 9505942 A	21-02-1996
EP 0398283	A	22-11-1990	AT 113597 T	15-11-1994
			AU 626418 B2	30-07-1992
			AU 5491490 A	22-11-1990
			CA 2016908 A1	16-11-1990
			CN 1047292 A ,B	28-11-1990
			DE 69013750 D1	08-12-1994
			DE 69013750 T2	24-05-1995
			DK 398283 T3	28-11-1994
			EP 0398283 A1	22-11-1990
			ES 2066035 T3	01-03-1995
			FI 95795 B	15-12-1995
			GR 3014893 T3	31-05-1995
			HU 54657 A2	28-03-1991
			IE 64671 B1	23-08-1995
			IL 94377 A	10-01-1997
			JP 3011067 A	18-01-1991
			JP 3014001 B2	28-02-2000
			KR 169107 B1	15-01-1999
			NO 902179 A ,B,	19-11-1990
			NZ 233641 A	28-07-1992
			PT 94042 A ,B	08-01-1991
			US 5026700 A	25-06-1991
			US 5112821 A	12-05-1992
			ZA 9003588 A	27-02-1991
US 5602144	A	11-02-1997	DE 4444815 A1	20-06-1996
			AU 703603 B2	25-03-1999
			AU 4029295 A	20-06-1996
			BR 9505899 A	06-01-1998
			CA 2165129 A1	16-06-1996
			CZ 9503193 A3	17-07-1996
			EP 0717044 A1	19-06-1996
			FI 956024 A	16-06-1996
			HU 75091 A2	28-04-1997
			JP 8239387 A	17-09-1996
			NO 955075 A	17-06-1996

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interr      Application No  
PCT/EP 02/02722

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5602144      A		PL      311838 A1	24-06-1996
		RU      2155766 C2	10-09-2000
		SK      157195 A3	03-07-1996
		TR      960544 A2	21-07-1996
		ZA      9510671 A	11-07-1996



## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/02722

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D487/04 C07D513/04 A61K31/505 A61P25/00 A61P29/00  
 //(C07D487/04,239:00,231:00),(C07D513/04,277:00,239:00)

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	US 5 789 406 A (ALLOUP JEAN-CLAUDE ET AL) 4. August 1998 (1998-08-04) das ganze Dokument	1-6,8-20
A	US 5 426 106 A (KULAGOWSKI JANUSZ J ET AL) 20. Juni 1995 (1995-06-20) das ganze Dokument	1-6,8-20
A	FR 2 722 786 A (RHONE POULENC RORER SA) 26. Januar 1996 (1996-01-26) das ganze Dokument	1-6,8-10
	--- -/-	



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*&amp;\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

6. September 2002

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

20. 09. 02

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Fritz, M

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inter les Aktenzeichen

PCT/EP 02/02722

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	KROGSGAARD-LARSEN P ET AL: "Design of excitatory amino acid receptor agonists, partial agonists and antagonists: ibotenic acid as a key lead structure" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR, Bd. 31, Nr. 7, 1996, Seiten 515-537, XP004040229 ISSN: 0223-5234 das ganze Dokument	1-6,8-20
A	EP 0 398 283 A (MERRELL DOW PHARMA) 22. November 1990 (1990-11-22) das ganze Dokument	1-5, 7-15,20
A	US 5 602 144 A (GOTTSCHLICH RUDOLF ET AL) 11. Februar 1997 (1997-02-11) das ganze Dokument	1-5, 7-15,20

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP 02/02722

## Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr. \_\_\_\_\_  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich \_\_\_\_\_
2. ☐ Ansprüche Nr. \_\_\_\_\_  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich \_\_\_\_\_
3. ☐ Ansprüche Nr. \_\_\_\_\_  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. ☒ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr. \_\_\_\_\_
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt: \_\_\_\_\_

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☒ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-5(Teil), 6, 8-15(Teil), 16-19, 20(Teil)

Verbindungen IA, IB, deren Herstellung, diese Verbindungen enthaltende Substanzbibliotheken, deren Verwendung zur Herstellung eines Arzneimittels sowie diese Verbindungen enthaltende pharmazeutische Zusammensetzungen.

2. Ansprüche: 1-5(Teil), 7-15(Teil), 20(Teil)

Verbindungen II, deren Herstellung, diese Verbindungen enthaltende Substanzbibliotheken, deren Verwendung zur Herstellung eines Arzneimittels sowie diese Verbindungen enthaltende pharmazeutische Zusammensetzungen.

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern  $\approx$  Aktenzeichen

PCT/EP 02/02722

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5789406	A	04-08-1998	FR 2717812 A1	29-09-1995
			AT 180483 T	15-06-1999
			AU 2141295 A	17-10-1995
			DE 69509888 D1	01-07-1999
			DE 69509888 T2	30-09-1999
			DK 752991 T3	08-11-1999
			EP 0752991 A1	15-01-1997
			ES 2134459 T3	01-10-1999
			WO 9526349 A1	05-10-1995
			GR 3030273 T3	31-08-1999
			JP 9510726 T	28-10-1997
			ZA 9502531 A	11-01-1996
US 5426106	A	20-06-1995	GB 2265372 A	29-09-1993
FR 2722786	A	26-01-1996	FR 2722786 A1	26-01-1996
			AU 2984695 A	16-02-1996
			EP 0772612 A1	14-05-1997
			WO 9602536 A1	01-02-1996
			JP 10504027 T	14-04-1998
			ZA 9505942 A	21-02-1996
EP 0398283	A	22-11-1990	AT 113597 T	15-11-1994
			AU 626418 B2	30-07-1992
			AU 5491490 A	22-11-1990
			CA 2016908 A1	16-11-1990
			CN 1047292 A ,B	28-11-1990
			DE 69013750 D1	08-12-1994
			DE 69013750 T2	24-05-1995
			DK 398283 T3	28-11-1994
			EP 0398283 A1	22-11-1990
			ES 2066035 T3	01-03-1995
			FI 95795 B	15-12-1995
			GR 3014893 T3	31-05-1995
			HU 54657 A2	28-03-1991
			IE 64671 B1	23-08-1995
			IL 94377 A	10-01-1997
			JP 3011067 A	18-01-1991
			JP 3014001 B2	28-02-2000
			KR 169107 B1	15-01-1999
			NO 902179 A ,B,	19-11-1990
			NZ 233641 A	28-07-1992
			PT 94042 A ,B	08-01-1991
			US 5026700 A	25-06-1991
			US 5112821 A	12-05-1992
			ZA 9003588 A	27-02-1991
US 5602144	A	11-02-1997	DE 4444815 A1	20-06-1996
			AU 703603 B2	25-03-1999
			AU 4029295 A	20-06-1996
			BR 9505899 A	06-01-1998
			CA 2165129 A1	16-06-1996
			CZ 9503193 A3	17-07-1996
			EP 0717044 A1	19-06-1996
			FI 956024 A	16-06-1996
			HU 75091 A2	28-04-1997
			JP 8239387 A	17-09-1996
			NO 955075 A	17-06-1996

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern s Aktenzeichen  
PCT/EP 02/02722

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5602144	A	PL 311838 A1	24-06-1996
		RU 2155766 C2	10-09-2000
		SK 157195 A3	03-07-1996
		TR 960544 A2	21-07-1996
		ZA 9510671 A	11-07-1996

---